

Bejelentés ügyszáma: P920  
 Közzétételi szám: 62565  
 Lajstromszám: Patent No. 217809

Bejelentés napja: 19920317  
 Közzététel napja: 19930528  
 Megadás napja: 20000128  
 Megadás meghírdetése: 20000428

Elsőbbségi adatok:  
 NSZO:

DEP4108824.7 - 19910318  
 C07D-213/81; C07D-295/192; A61K-031/44; A61K-031/535

#### Magyar cím:

Piridin-2,4-dikarbonsav-diamidok és ezeket tartalmazó gyógyszerkészítmények, és eljárás előállításukra

#### Angol cím:

PYRIDINE-2,4-DICARBOXYLIC ACID DIAMIDES, PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS COMPRISING THE SAME AND PROCESS FOR PRODUCING THEM

#### Bejelentő:

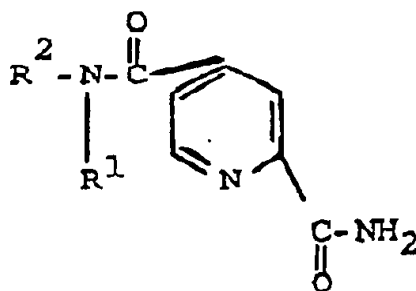
Hoechst Ag., Frankfurt/Main, DE

#### Feltaláló:

dr. Baader, Ekkehard, Königstein/Taunus, DE  
 dr. Bickel, Martin, Bad Homburg, DE  
 dr. Günzler-Pukall, Volkmar, Marburg, DE  
 dr. Volz, Manfred, Usingen, DE

#### Képviselő:

Schláfer László, DANUBIA Szabadalmi és Védjegy Iroda Kft., Budapest, HU



#### Kivonat:

A találmány szerinti vegyületek (I) általános képletében R1 jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben 1-4 szénatomos alkoxycsoporttal, hidroxilcsoporttal vagy adott esetben fenil-(1-4 szénatomos alkil)-csoporttal szubsztituált karboxilcsoporttal szubsztituálva lehet, R2 jelentése hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport, vagy R1 és R2 a kapcsolódó nitrogénatommal együtt morfolinocsoportot képez. A találmány kiterjed a fenti vegyületek előállítására, valamint a fenti vegyületeket tartalmazó gyógyszerkészítményekre és ezek előállítására. A vegyületek kollagénbioszintézist gátló hatásúak.

#### Igéypont:

- (I) általános képletű piridin-2,4-dikarbonsav-diamidok és fiziológiailag alkalmazható sóik, a képletben R1 jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben 1-4 szénatomos alkoxycsoporttal, hidroxilcsoporttal vagy adott esetben fenil-(1-4 szénatomos alkil)-csoporttal szubsztituált karboxilcsoporttal szubsztituálva lehet, R2 jelentése hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport, vagy R1 és R2 a kapcsolódó nitrogénatommal együtt morfolinocsoportot képez.
- Eljárás (I) általános képletű piridin-2,4-dikarbonsav-diamidok és fiziológiailag alkalmazható sóik előállítására, a képletben R1 jelentése 1-6 szénatomos alkilcsoport, amely adott esetben 1-4 szénatomos alkoxycsoporttal, hidroxilcsoporttal vagy adott esetben fenil-(1-4 szénatomos alkil)-csoporttal szubsztituált karboxilcsoporttal szubsztituálva lehet, R2 jelentése hidrogénatom vagy 1-6 szénatomos alkilcsoport, vagy R1 és R2 a kapcsolódó nitrogénatommal együtt morfolinocsoportot képez, azzal jellemezve, hogy egy (IV) általános képletű vegyületet, ahol R1 és R2 jelentése a tárgyi körben megadott, ammóniával reagáltatunk, és a kapott (I) általános képletű vegyületet kívánt esetben fiziológiailag alkalmazható sóvá alakítjuk.
- Gyógyszerkészítmény, amely (I) általános képletű vegyületet

segédanyagok mellett.

4. Az 1. igénypont szerinti vegyületek prolin- és lizin-hidroxiláz gátlására.

5. Az 1. igénypont szerinti vegyületek fibroszupresszívaként és immunszupresszívaként történő alkalmazásra.

6. Az 1. igénypont szerinti vegyületek kollagén és kollagénszerű anyagok anyagcseréjét befolyásoló eljárásban történő alkalmazásra.

7. Az 1. igénypont szerinti vegyületek kollagén és kollagénszerű anyagok anyagcseréjének zavarai kezelésében történő alkalmazásra.

8. Eljárás gyógyszerkészítmények előállítására, azzal jellemezve, hogy valamely, a 2. igénypont szerint előállított (I) általános képletű vegyületet és/vagy fiziológiailag alkalmazható sóját, a képletben R1 és R2 jelentése a 2. igénypontban megadott, gyógyszerészeti hordozóanyaggal és adott esetben egyéb gyógyszerészeti segédanyaggal keverünk, és a keveréket gyógyszerkészítménnyé alakítjuk.

① P.2